
VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

REC'D 0 4 JAN 2005

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT UBER DIE PCT PATENTIERBARKEIT

(Kapitel II des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet

| Aktenzeichen des Anmelders o 0000054239 | WEITERES VOR | GEHEN | siehe Formblatt PCT/IPEA/416 |
|--|--|--|---|
| Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/000237 | Internationales Anmel 15.01.2004 | dedatum (Tag/Monat/Jahr) | Prioritätsdatum (TagMonat/Jahr) 22.01.2003 |
| Internationale Patentklassifikati C07D333/22 | n (IPK) oder nationale Klassifikation | und IPK | L |
| Anmelder BASF AKTIENGESELLS | HAFT et al. | | |
| Bei diesem Bericht har internationalen vorläufi Artikel 36 übermittelt w | delt es sich um den international en Prüfung beauftragten Behörd d. | en vorläufigen Prüfungsbe de nach Artikel 35 erstellt v | ericht, der von der mit der wurde und dem Anmelder gemäß |
| | t insgesamt 5 Blätter einschließ | | - |
| 3. Außerdem liegen dem | Bericht ANLAGEN bei; diese umf | icon uleses Deckblatts. | |
| a. 🗌 (an den Anmelo | er und das Internationale Büro ge | assen | |
| zugrunde lie | ti Description Aperical | d/oder Zeichnungen, die g | dabei handelt es sich um jeändert wurden und diesem Berich de zugestimmt hat (siehe Regel |
| ☐ Blätter, die t Gründen na | ühere Blätter ersetzen die alle | aus den in Feld Nr. 1, Pur | nkt 4 und im Zusatzfeld angegebene |
| Datenträger(s) a nur in computeri | nationale Büro gesandt)i> insges | amt (bitte Art und Anzahl | der/des elektronischen ehörigen Tabellen enthält/enthalten otokoll angegeben (siehe Abschnitt |
| . Dieser Bericht enthält A | gaben zu folgenden Punkten: | | |
| ☑ Feld Nr. I Grund | age des Bescheids | | |
| ☐ Feld Nr. II Priorit | | | |
| | Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit | | |
| Feld Nr. IV Mange | Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung | | |
| ⊠ Feld Nr. V Begrü und de | Begründete Feststellung nach Arikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung | | |
| — Formatti VI Destill | bestimme angelunite Unterlagen | | |
| ☐ Feld Nr. VII Bestim | Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung | | |
| ☐ Feld Nr. VIII Bestim | nte Bemerkungen zur internatior | nalen Anmeldung | |
| atum der Einreichung des Antrag | | Datum der Fertigstellung die | ses Berichts |
| 2.11.2004 | | 30.12.2004 | |
| ame und Postanschrift der mit de | International on Professor | | |
| aumagien Benorge | | Bevollmächtigter Bedienstete | er Pales. |
| Europäisches Paten D-80298 München | | Stroeter, T | South Miles |
| Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465 | | Tel. +49 89 2399-8088 | |
| | | | |

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/000237

| _ | Feld Nr. I Grundlage des Berichte |
|------------------------|---|
| | man-11-35 des Derichis |
| 1. | Hinsichtlich der Sprach e beruht der Bericht auf der internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist. |
| | Der Bericht beruht auf einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für folgenden Zweck eingereicht worden ist: ☐ internationale Recherche (nach Regeln 12.3 und 23.1 b)) ☐ Veröffentlichung der internationalen Anmeldung (nach Regel 12.4) ☐ internationale vorläufige Prüfung (nach Regeln 55.2 und oder 55.2) |
| 2. | Hinsichtlich der Bestandteile* der internationalen Anmeldung beruht der Bericht auf (<i>Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigefügt):</i> |
| ! | Beschreibung, Seiten |
| • | in der ursprünglich eingereichten Fassung |
| 1 | Ansprüche, Nr. |
| 1 | in der ursprünglich eingereichten Fassung |
| Z | Zeichnungen, Blätter |
| 1. | /I in der ursprünglich eingereichten Fassung |
| S |] einem Sequenzprotokoll und/oder etwaigen dazugehörigen Tabellen - siehe Zusatzfeld betreffend das equenzprotokoll |
| 3. | Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen: □ Beschreibung: Seite □ Ansprüche: Nr. □ Zeichnungen: Blatt/Abb. □ Sequenzprotokoll (genaue Angaben): □ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (genaue Angaben): |
| 4. □ au Aι (R | |
| * "e: | Wenn Punkt 4 zutrifft, können einige oder alle dieser Blätter mit der Bemerkung rsetzt" versehen werden. |

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/000237

Begründete Feststellung nach Artikel 35 (2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser

1. Feststellung

Neuheit (N)

Ja: Ansprüche 1-8

Erfinderische Tätigkeit (IS)

Nein: Ansprüche Ja: Ansprüche 1-8

Gewerbliche Anwendbarkeit (IA)

Nein: Ansprüche Ja: Ansprüche: 1-8

Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):

siehe Beiblatt

Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen

1. Bestimmte veröffentlichte Unterlagen (Regel 70.10) und / oder

2. Nicht-schriftliche Offenbarungen (Regel 70.9)

siehe Beiblatt

Zu Punkt V

Begründete Feststellung hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1 <u>Der Gegenstand der unabhängigen Patentansprüche</u>

Die vorliegende Anmeldung betrifft 3-Methylamino-1-(2-thienyl)-1-propanon und seine Säureadditionssalze (unabhängiger Anspruch 1) sowie die Verwendung dieser Verbindungen (unabhängiger Anspruch 3) als Intermediate in der Darstellung von Duloxetin bzw. Verfahren hierzu (unabhängiger Anspruch 6).

Anmerkung: Produktanspruch 2 wurde vermutlich versehentlich als unabhängiger Anspruch formuliert und sollte als abhängig von Anspruch 1 formuliert werden.

2 <u>Dokumente zum Stand der Technik</u>

Es wird auf die folgenden Dokumente verwiesen. Die angegebene Numerierung der Dokumente wird auch im weiteren Verfahren beibehalten:

D1: WO 2004/020391 A (MERCK PATENT GMBH; NIESERT CLAUS-PETER (DE); FABIAN KAI (DE); KRALIK) 11. März 2004

D2: EP-A-0 457 559 (LILLY CO ELI) 21. November 1991

D3: LIU H ET AL: "CHEMO-ENZYMATIC SYNTHESIS OF THE ANTIDEPRESSANT DULOXETINE AND IST ENANTIOMER" CHIRALITY, WILEY-LISS, NEW YORK, US, Bd. 12, Nr. 1, 2000, Seiten 26-29

Zu D1 bitte siehe Punkt VI. D1 wird im Folgenden nicht weiter berücksichtigt.

3 Neuheit (Artikel 33(2) PCT) und Erfinderische Tätigkeit (Artikel 33(3) PCT)

Die in den Ansprüchen 1 und 2 beanspruchten Verbindungen sind neu gegenüber D2, D3 und sonstigen Dokumenten zum Stand der Technik im Sinne von Regel 64.1(b) PCT. Gleiches gilt demgemäß für die Verwendungs- bzw. Verfahrensansprüche 3 bis 8, welche die Verwendung dieser Verbindungen als Intermediate in der Darstellung von Duloxetin beinhalten.

Die vorliegenden Ansprüche 1 bis 8 sind erfinderisch, da die aus dem nächstliegenden Stand der Technik D2 und D3 bekannten Verfahren unterschiedliche Syntheserouten offenbaren: Im Stand der Technik wird stets zunächst die Alkoholfunktion durch Reduktion des entsprechenden Carbonylprecursors gebildet bevor die Monomethyl-Aminogruppe eingeführt wird. Demnach wurde vorliegende technische Aufgabe, ein alternatives Verfahren zur Darstellung von Duloxetin bereitzustellen in nicht-naheliegender, erfinderischer Weise gelöst.

4 Gewerbliche Anwendbarkeit (Artikel 33(4) PCT)

in der vorliegenden Anmeldung dargelegten Patentansprüche 1 bis 8 sind gewerblich anwendbar gemäß Artikels 33(4) PCT.

Zu Punkt VI

Bestimmte angeführte Unterlagen

Obwohl das Dokument D1 kein Stand der Technik im Sinne von Regel 64.1(b) PCT ist, wird darauf hingewiesen, daß dieses Dokument in den Ansprüchen 1 und 2 beanspruchten Verbindungen vorwegnimmt.

Es wird darauf hingewiesen, daß keine Prüfung hinsichtlich der Frage zur Gültigkeit der Priorität, durchgeführt worden ist.